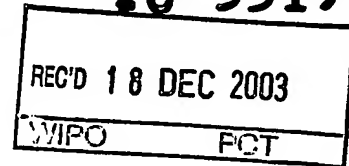


BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

Rec'd PCT/PTO 20 APR 2005

EP 03/12277

10/531981

Prioritätsbescheinigung über die Einreichung
einer Patentanmeldung

Aktenzeichen: 102 52 261.8

Anmeldetag: 7. November 2002

Anmelder/Inhaber: BASF Aktiengesellschaft, Ludwigshafen/DE

Bezeichnung: 5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine, Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen

IPC: C 07 D, A 01 N

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

München, den 2. September 2003
Deutsches Patent- und Markenamt

Der Präsident

Im Auftrag

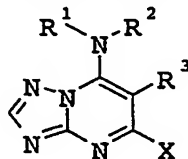
BEST AVAILABLE COPY

**PRIORITY
DOCUMENT**

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

Patentansprüche

1. 5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine der Formel I,



10 in der die Substituenten die folgenden Bedeutungen haben:

R^1, R^2 Wasserstoff, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkiny-
15 nyl, C_1 - C_{10} -Haloalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, Phenyl, Naph-
thyl; oder

5- oder 6-gliedriges gesättigtes, ungesättigtes oder
aromatisches Heterocycl, enthaltend ein bis vier
Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und
20 ein Schwefel- oder Sauerstoffatom; oder

R^1 und R^2 können zusammen mit dem Stickstoffatom, das
sie verbindet, einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden,
der ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei
Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom
25 enthält;

R^1 und R^2 können, wenn ungleich Wasserstoff, unabhängig
voneinander teilweise oder vollständig halogeniert sein
und/oder einen bis drei Reste aus der Gruppe R^a tragen

30 R^a Cyano, Nitro, Hydroxy, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halo-
alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloal-
koxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di-
 C_1 - C_6 -alkylamino, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy,
35 C_2 - C_6 -Alkiny, C_3 - C_6 -Alkinyloxy und gegebenenfalls
halogeniertes Oxy- C_1 - C_4 -alkylenoxy;

R^3 C_3 - C_{14} -Cycloalkyl oder C_6 - C_{14} -Bicycloalkyl, wobei R^3 un-
substituiert oder teilweise oder vollständig haloge-
niert sein kann und/oder ein bis drei Reste aus der
Gruppe R^a tragen kann; und

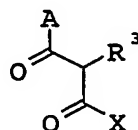
40 X C_1 - C_6 -Alkyl;

45 sowie deren Salze.

2

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Methyl steht.

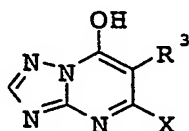
3. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man Dicarbonylverbindungen der Formel II



II

10

wobei A für C₁-C₁₀-Alkoxy und R³ und X wie für Formel I definiert ist, mit 3-Amino-1,2,4-triazol zu 7-Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel III

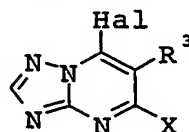


III

15

cyclisiert und III mit einem Halogenierungsmittel zu 7-Halogentriazolopyrimidinen der Formel IV

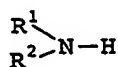
20



IV

25

halogeniert, wobei Hal für Halogen steht, und anschließend mit einem Amin der Formel V



V

30 worin R¹ und R² wie in Formel I definiert sind, zu 5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidinen der Formel I umsetzt.

4. Verbindungen der Formeln IV und V gemäß Anspruch 3.

35 5. Zur Bekämpfung von phytopathogenen Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.

6. Verwendung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 zur Herstellung eines zur Bekämpfung von Schadpilzen geeigneten Mittels.

7. Verfahren zur Bekämpfung von phytopathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

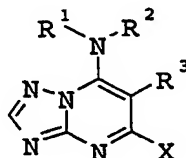
5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine, Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen

5

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft 5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine der Formel I,

10



15 in der die Substituenten die folgenden Bedeutungen haben:

R^1, R^2 Wasserstoff, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkynyl, C_1 - C_{10} -Haloalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl; oder

20

5- oder 6-gliedriges gesättigtes, ungesättigtes oder aromatisches Heterocyclyl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom; oder

25

R^1 und R^2 können zusammen mit dem Stickstoffatom, das sie verbindet, einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält;

30

R^1 und R^2 können, wenn ungleich Wasserstoff, unabhängig voneinander teilweise oder vollständig halogeniert sein und/oder einen bis drei Reste aus der Gruppe R^a tragen

35

R^a Cyano, Nitro, Hydroxy, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di- C_1 - C_6 -alkylamino, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_3 - C_6 -Alkynyloxy und gegebenenfalls halogeniertes Oxy- C_1 - C_4 -alkylenoxy;

40

45

R^3 C_3 - C_{14} -Cycloalkyl oder C_6 - C_{14} -Bicycloalkyl, wobei R^3 unsubstituiert oder teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe R^a tragen kann; und

X C₁-C₆-Alkyl;

sowie deren Salze.

5 Zusätzlich betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung der Verbindungen I, sowie Mittel und die Verwendung der Verbindungen I zur Bekämpfung von phytopathogenen Schädlingen.

10 6-Aryl-Triazolopyrimidine werden in WO 98/46608 und EP-A 550 113 offenbart. Durch aromatische Gruppen speziell substituierte 6-Benzyl-Triazolopyrimidine mit pharmazeutischer Wirkung sind aus US 5,231,094 und US 5,387,747 bekannt. EP-A 141 317 offenbart 6-Aryl- und 6-Arylalkyl-7-aminotriazolopyrimidine, welche in 15 5-Position einen Alkylrest tragen können. 6-Cycloalkyltriazo-
pyrimidine mit diversen Resten in 5-Position werden in EP-A 613 900 genannt. 5-Alkyl-6-phenyl-7-aminotriazolopyrimidine sind aus US 5,994,360 bekannt.

20 Die in WO 98/46608, EP-A 550 113, EP-A 141 317, EP-A 613 900 und US 5,994,360 beschriebenen Verbindungen sind als Pflanzenschutzmittel gegen Schädlinge geeignet.

Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend.

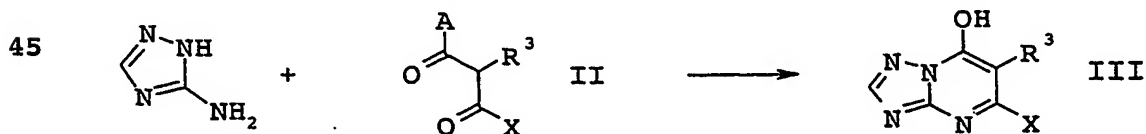
25 Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirksamkeit zu finden.

Demgemäß wurden die 5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine der Formel I gefunden. Weiterhin wurden Zwischenprodukte und Verfahren zur

30 Herstellung der Verbindungen I, sowie die Verwendung der Verbindungen I und diese enthaltende Mittel zur Bekämpfung von phytopathogenen Schädlingen gefunden.

Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den 35 oben genannten Schriften bekannten Verbindungen durch die Kombination der 5-Alkylgruppe mit der als mono- oder bicyclischer Cycloalkylgruppe R³ am Triazolopyrimidingerüst.

7-Aminotriazolopyrimidine der Formel I, sind vorteilhaft erhältlich 40 lich durch Umsetzung von 3-Amino-1,2,4-triazol mit Dicarboxylverbindungen der Formel II, wobei A für C₁-C₁₀-Alkoxy, insbesondere für C₁-C₄-Alkyl steht und R³ und X wie für Formel I definiert sind, zu 7-Hydroxytriazo-
pyrimidinen der Formel III:



3

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 25°C bis 210°C, vorzugsweise 120°C bis 180°C, in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A-770 615].

5 Als Basen kommen allgemein organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Triisopropyl-ethylamin, Tri-butylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin in Betracht. Besonders bevorzugt werden Triethylamin und Tributylamin.

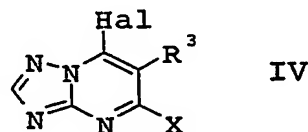
10 Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, II in einem Überschuß bezogen auf das Aminotriazol einzusetzen.

Die für die Herstellung der Verbindungen I benötigten Ausgangsstoffe sind in der Literatur bekannt oder können gemäß der
20 zitierten Literatur hergestellt werden [Heterocycl. 1996, S.1031; Tetrahedron Lett. 1966, Bd.24, S.2661; Chem. Pharm. Bull. 1961, S.801] oder sind kommerziell zugänglich.

Anschließend setzt man die 7-Hydroxytriazolopyrimidine der Formel
25 III mit einem Halogenierungsmittel zu 7-Halogentriazolopyrimidinen der Formel IV um:

III



30

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise 80°C bis 125°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel oder ohne Lösungsmittel [vgl. EP-A-770 615].

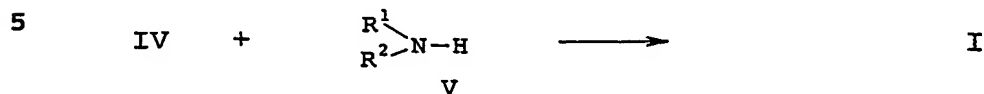
35 Als Halogenierungsmittel kommen bevorzugt Bromierungs- oder Chlorierungsmittel, wie beispielsweise Phosphoroxobromid oder Phosphoroxochlorid, in Substanz oder in Anwesenheit eines Lösungsmittels in Frage.

40 Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, besonders bevorzugt Toluol, o-, m- und p-Xylol. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

45

4

Die Halogentriazolopyrimidine der Formel IV werden mit einem Amin der Formel V zu 7-Aminotriazolopyrimidinen der Formel I umgesetzt.



Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 70°C, vorzugsweise 10°C bis 35°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A 550 113].

Geeignete Lösungsmittel sind aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallalloxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride, Alkalimetallamide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle, Alkylmagnesiumhalogenide sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Triethylamin, Kaliumcarbonat und Natriumcarbonat.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden. Alternativ dazu kann ein Überschuß der Verbindung V als Base dienen.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, V in einem Überschuß bezogen auf IV einzusetzen.

40

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe

5

erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

5 Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

7-Hydroxy- und 7-Halogentriazolopyrimidine der Formeln III und IV, wobei X und R³ die Bedeutung wie in Formel I hat und Hal Halogen, insbesondere Chlor oder Brom bedeutet, sind neu.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

15

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen, z.B.

20 C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 25 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

30 Haloalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise, beispielsweise ein- bis dreifach, oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C₁-C₂-Haloalkyl wie Chlormethyl,

35 Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Pentafluorethyl;

Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 6 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkenyl wie 45 Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl,

6

- 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl,
3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl,
3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl,
3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-pro-
5 penyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-
propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl,
1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl,
4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl,
3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl,
10 2-Methyl-3pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl,
1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl,
4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-bute-
nyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dime-
thyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl,
15 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-
butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Di-
methyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl,
1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl,
2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl,
20 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und
1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

- Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen
mit 2 bis 6 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung
25 in einer beliebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkynyl wie Ethinyl,
1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl,
1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Penti-
nyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-
butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-
30 propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl,
1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl,
2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl,
3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl,
1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-
35 butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl,
1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und
1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

- Cycloalkyl: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen
40 mit 3 bis 5, 6, oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C₃-C₈-Cyclo-
alkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl,
Cycloheptyl und Cyclooctyl;

Bicycloalkyl: bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 6 bis 14, insbesondere 7 oder 10 Kohlenstoffringgliedern, bestehend aus annelierten 5-, 6- und/oder 7-gliederigen Ringsystemen.

5

- 5- oder 6-gliedrige Heterocyclen (gesättigtes Heterocyclyl) enthaltend neben Kohlenstoffringgliedern ein bis vier Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- und/oder Schwefelatom, z.B. 2-Tetrahydrofuran-yl, 3-Tetrahydrofuran-yl, 2-Tetrahydrothien-yl, 3-Tetrahydrothien-yl, 2-Pyrrolidin-yl, 3-Pyrrolidin-yl, 3-Isioxazolidin-yl, 4-Isioxazolidin-yl, 5-Isioxazolidin-yl, 3-Isiothiazolidin-yl, 4-Isiothiazolidin-yl, 5-Isiothiazolidin-yl, 3-Pyrazolidin-yl, 4-Pyrazolidin-yl, 5-Pyrazolidin-yl, 2-Oxazolidin-yl, 4-Oxazolidin-yl, 5-Oxazolidin-yl, 2-Thiazolidin-yl, 4-Thiazolidin-yl, 5-Thiazolidin-yl, 2-Imidazolidin-yl, 4-Imidazolidin-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-3-yl, 2,4-Dihydrofuran-2-yl, 2,4-Dihydrofuran-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isioxazolin-3-yl, 3-Isioxazolin-3-yl, 4-Isioxazolin-3-yl, 2-Isioxazolin-4-yl, 3-Isioxazolin-4-yl, 4-Isioxazolin-4-yl, 2-Isioxazolin-5-yl, 3-Isioxazolin-5-yl, 4-Isioxazolin-5-yl, 2-Isiothiazolin-3-yl, 3-Isiothiazolin-3-yl, 4-Isiothiazolin-3-yl, 2-Isiothiazolin-4-yl, 3-Isiothiazolin-4-yl, 4-Isiothiazolin-4-yl, 2-Isiothiazolin-5-yl, 3-Isiothiazolin-5-yl, 4-Isiothiazolin-5-yl, 2,3-Dihidropyrazol-1-yl, 2,3-Dihidropyrazol-2-yl, 2,3-Dihidropyrazol-3-yl, 2,3-Dihidropyrazol-4-yl, 2,3-Dihidropyrazol-5-yl, 3,4-Dihidropyrazol-1-yl, 3,4-Dihidropyrazol-3-yl, 3,4-Dihidropyrazol-4-yl, 3,4-Dihidropyrazol-5-yl, 4,5-Dihidropyrazol-1-yl, 4,5-Dihidropyrazol-3-yl, 4,5-Dihidropyrazol-4-yl, 4,5-Dihidropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidin-yl, 3-Piperidin-yl, 4-Piperidin-yl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyran-yl, 4-Tetrahydropyran-yl, 2-Tetrahydrothien-yl, 3-Hexahidropyridazin-yl, 4-Hexahidropyridazin-yl, 2-Hexahidropyrimidin-yl, 4-Hexahidropyrimidin-yl, 5-Hexahidropyrimidin-yl, 2-Piperazin-yl, 1,3,5-Hexahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl;

- 45 5-gliedriges Heteroaryl (aromatisches Heterocyclyl), enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen,

welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isotiazolyl, 4-Isotiazolyl, 5-Isotiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;

6-gliedriges Heteroaryl (aromatisches Heterocyclyl), enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;

20

Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH_2 -Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH_2O , $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ und $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$;

25 Die Verbindungen der Formel I können auch in Form ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es in der Regel nicht auf die Art des Salzes ankommt. Im Allgemeinen kommen die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen beziehungsweise Anionen die fungizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen.

Es kommen als Kationen insbesondere Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Lithium, Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium und Magnesium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie Ammonium, wobei hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch C_1 - C_4 -Alkyl, Hydroxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, Hydroxy- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, Phenyl oder Benzyl ersetzt sein können, Vorzugsweise Ammonium, Dimethylammonium, Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, 2-(2-Hydroxyeth-1-oxy)eth-1-ylammonium, Di(2-hydroxyeth-1-yl)ammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren, Phosphoniumionen, Sufoniumionen, vorzugsweise $\text{Tri}(\text{C}_1$ - C_4 -alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise $\text{Tri}(\text{C}_1$ - C_4 -alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

9

Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen
5 von C₁-C₄-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.

Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der 5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Be-
10 deutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R¹ und R² für Wasserstoff, C₁-C₁₀-Alkyl oder C₁-C₆-Haloalkyl, insbesondere für Wasserstoff,
15 C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Haloalkyl, besonders bevorzugt für Wasserstoff, 1-Methylpropyl, Isopropyl oder 1,1,1-Trifluor-2-propyl steht.

Bevorzugt sind auch Verbindungen I, in denen R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, das sie verbindet, einen 5-oder 6-gliedrigen Ring bilden, der ein Sauerstoffatom enthalten kann, wie
20 Pyrrolidin-1-yl, Pyrrol-1-yl, Pyrazol-1-yl, Imidazol-1-yl, Piperidin-1-yl, Morpholin-4-yl, wobei die genannten Reste durch eine bis drei Gruppen R^a, insbesondere durch C₁-C₄-Alkyl, wie beispielsweise Methyl oder Ethyl, substituiert sein können.

25 Daneben werden auch Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R¹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl und C₁-C₄-Haloalkyl und R² Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, insbesondere Wasserstoff, bedeutet.

30 Ganz besonders werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen R³ C₃-C₈-Cycloalkyl, bevorzugt Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl bedeuten.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen X
35 Methyl bedeutet.

Inbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen
40 außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

Tabelle 1

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclopropyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 2

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclopropyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclopropyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclopropyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 5

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclopentyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 6

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclopentyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 7

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclopentyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 8

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclopentyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 9

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclohexyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

Tabelle 10

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclohexyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 11

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclohexyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 12

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclohexyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 13

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cycloheptyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 14

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cycloheptyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 15

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cycloheptyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 16

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cycloheptyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 17

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclooctyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 18

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclooctyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

12

Tabelle 19

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclooctyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 20

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclooctyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 21

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclododecyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 22

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclododecyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 23

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclododecyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 24

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyclododecyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 25

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 26

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 27

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

Tabelle 28

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5 spricht

Tabelle 29

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 2-Methylcyclopentyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 30

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 2-Methylcyclopentyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 31

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 2-Methylcyclopentyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 32

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 2-Methylcyclopentyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 33

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 3-Methylcyclopentyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 34

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 3-Methylcyclopentyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 35

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 3-Methylcyclopentyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 36

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 3-Methylcyclopentyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

Tabelle 37

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 2-Methylcyclohexyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 38

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 2-Methylcyclohexyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 39

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 2-Methylcyclohexyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 40

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 2-Methylcyclohexyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 41

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 3-Methylcyclohexyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 42

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 3-Methylcyclohexyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 43

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 3-Methylcyclohexyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 44

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 3-Methylcyclohexyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 45

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für 4-Methylcyclohexyl, X für Methyl steht und die Kombination der Reste R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

Tabelle 46

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 4-Methylcyclohexyl, X für Ethyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 47

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 4-Methylcyclohexyl, X für n-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

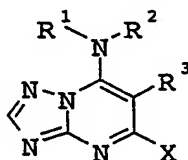
10

Tabelle 48

Verbindungen der Formel I, in denen R³ für 4-Methylcyclohexyl, X für iso-Propyl steht und die Kombination der Reste R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle A



I

20

No.	R ¹	R ²
A-1	H	H
A-2	CH ₂ CH ₃	H
25 A-3	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-4	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-5	CH ₂ CF ₃	H
A-6	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-7	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
30 A-8	CH ₂ CCl ₃	H
A-9	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-10	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-11	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-12	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
35 A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-14	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-15	CH(CH ₃) ₂	H
A-16	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-17	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
40 A-18	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-19	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-20	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-21	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-22	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
45 A-23	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-24	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-25	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃

No.	R ¹	R ²
A-26	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-27	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-28	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
5 A-29	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-30	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-31	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-32	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
10 A-33	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-34	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-35	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-36	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-37	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
15 A-38	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-39	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-40	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-41	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-42	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
20 A-43	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-44	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-45	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-46	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-47	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
25 A-48	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-49	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-50	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-51	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-52	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
30 A-53	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-54	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-55	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-56	(R/S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-57	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
35 A-58	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-59	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-60	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-61	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
40 A-62	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-63	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-64	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-65	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-66	cyclopentyl	H
45 A-67	cyclopentyl	CH ₃
A-68	cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
A-69	-(CH ₂) ₄ -	

17

No.	R ¹	R ²
A-70	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -	
A-71	-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-72	-(CH ₂) ₅ -	
A-73	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-74	-CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ -	

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste R¹, R², R^a, R³ und X der Formel I.

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Phycomyceten* und *Basidiomyceten*, aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- 30 · *Alternaria*-Arten, *Podosphaera*-Arten, *Sclerotinia*-Arten, *Physalospora* canker an Gemüse und Obst,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Corynespora cassiicola* an Gurken,
- 35 · *Colletotrichum*-Arten an Obst und Gemüse,
- *Diplocarpon rosae* an Rosen,
- *Elsinoe fawcetti* und *Diaporthe citri* an Citrus-Früchten,
- *Sphaerotheca*-Arten an Kürbisgewächsen, Erdbeeren und Rosen,
- *Cercospora*-Arten an Erdnüssen, Zuckerrüben und Auberginen,
- 40 · *Erysiphe cichoracearum* an Kürbisgewächsen,
- *Leveillula taurica* an Paprika, Tomaten und Auberginen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Äpfeln und japanischer Aprikose,
- *Phyllactinia kakicola*, *Gloesporium kaki*, an japanischer Aprikose,
- 45 · *Gymnosporangium yamadae*, *Leptothyrium pomi*, *Podosphaera leucotricha* und *Gloedes pomigena* an Äpfeln,
- *Cladosporium carpophilum* an Birnen und japanischer Aprikose,

18

- *Phomopsis*-Arten an Birnen,
- *Phytophthora*-Arten an Citrusfrüchten, Kartoffeln, Zwiebeln, insbesondere *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- 5 · *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Glomerella cingulata* an Tee,
- *Drechslera*- und *Bipolaris*-Arten an Getreide und Reis,
- *Mycosphaerella*-Arten an Bananen und Erdnüssen,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- 10 · *Personospora*-Arten an Zwiebeln, Spinat und Chrysantemen,
- *Phaeoisariopsis vitis* und *Sphaceloma ampelina* an Grapefruits,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten und *Typhula*-Arten an Getreide und Rasen,
- 15 · *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Stagonospora nodorum* und *Septoria tritici* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- 20 · *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im

25 Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der

30 Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und

35 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2 kg Wirkstoff pro ha.

40

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

45 Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Mate-

rialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen über-
5 führt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

10

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungs-
15 mittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und
20 Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nicht-ionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fett-
25 alkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenol-
30 sulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykoether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensati-
35 onsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenol-polyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Alkylaryl-polyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Konden-
40 sate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen,
45 Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, ali-

20

phatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.

10 Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder ge-
meinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen
Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe
15 hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden,
wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und
25 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind:

30

I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

35

II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit
40 guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).

45

III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen

des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).

- IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in
5 einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon,
30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungs-
produktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol
und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethy-
10 lenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16
Gew.-%).
- V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit
3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin-
15 alpha-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer
Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-
Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in
einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).
- VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbin-
20 dung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl-a-pyrrolidon und erhält
eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen
geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).
- VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in
25 einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon,
30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungs-
produktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol
und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol
Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und
30 feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser
erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des
Wirkstoffs enthält.
- VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit
35 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin-a-
sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Lignin-
sulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen
pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer
Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung
40 in 20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe,
die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen
oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von di-
45 rekt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Disper-
sionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streu-
mitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Ver-

22

streuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

5

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder
10 in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit
15 Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen
20 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff
25 ohne Zusätze auszubringen.

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zuge-
30 setzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der
35 z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

40

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

45 · Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbis-dithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zink-

23

- ethylendiamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide, Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-propylenbis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylen-bis-(thiocarbamoyl)disulfid;
- 5 Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthal-säure-di-isopropylester;
- 10 heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2-Chlor-N-(4'-chlor-biphenyl-2-yl)-nicotinamid, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethyl-phthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol, 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-phthalimid,
- 15 N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäurediamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanmethylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazon, Pyridin-2-thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoesäure-anilid, 2-Iod-benzoesäure-anilid, N-Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-1-(2,2,2-trichlorethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholin, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-piperidin, 8-tert.-Butyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-ylmethyl(ethyl)(propyl)amin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff,
- 20 25 30 35 40 45

- 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol, (2RS,3RS)-1-[3-(2-Chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)-oxiran-2-ylmethyl]-1H-1,2,4-triazol,
- 5 (RS)-2-[2-(1-Chlorcyclopropyl)-3-(2-chlorphenyl)-2-hydroxypropyl]-2,4-dihydro-1,2,4-triazol-3-thion, α -(4-Chlorphenyl)- α -(1-cyclopropylethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, α -(2-Chlorphenyl)- α -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
- 10 Strobilurine wie Methyl-E-methoxyimino-[α -(o-tolyloxy)-o-tolyl]acetat, Methyl-E-2-{2-[6-(2-cyanophenoxy)-pyrimidin-4-yloxy]-phenyl}-3-methoxyacrylat, Methyl-E-methoxyimino-[α -(2-phenoxyphenyl)]-acetamid, Methyl-E-methoxyimino-[α -(2,5-dimethylphenoxy)-o-tolyl]-acetamid, Methyl-E-2-{2-[2-trifluormethylpyridyl-6-]oxymethyl}-phenyl}-3-methoxyacrylat, (E,E)-Methoximino-{2-[1-(3-trifluormethylphenyl)-ethylidenaminooxymethyl]-phenyl}-essigsäuremethylester, Methyl-N-(2-{[1-(4-chlorphenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxymethyl}-phenyl)N-methoxy-carbammat,
- 15 Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin, N-[4-Methyl-6-(1-propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin, N-[4-Methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl]-anilin,
- 20 Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyrrol-3-carbonitril,
- 25 Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-acrylsäuremorpholid und 3-(4-Fluorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-acrylsäuremorpholid,
- 30 sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat, 1-(3-Brom-6-methoxy-2-methyl-phenyl)-1-(2,3,4-trimethoxy-6-methyl-phenyl)-methanon, 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methyl-ester, N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-alaninmethylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxazolidin- 2,4-dion,
- 35 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylehydantoin, N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbonssäureimid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbo-nyl)-2-methoximino]-acetamid,
- 40 45

25

1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pen-tyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Di-
fluor-a-(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalkohol,
N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-trifluorme-
thyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-methylsi-
5 ly)-methyl)-1H-1,2,4-triazol, 5-Chlor-2-cyano-4-p-tolyl-imida-
zol-1-sulfonsäuredimethylamid, 3,5-Dichlor-N-(3-chlor-1-ethyl-
1-methyl-2-oxo-propyl)-4-methyl-benzamid, Isopropyl-2-me-
thyl-1-[(1-p-tolyloethyl)carbamoylethyl]-(S)-propylcarbamate,
10 amoyl}-2-methylpropyl]carbaminsäure, 6-Iod-2-propoxy-3-propyl-
chinazolin-4(3H)-on.

Synthesebeispiele

15 Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vor-
schriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsver-
bindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so
erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit
physikalischen Angaben aufgeführt.

20

Beispiel 1 Herstellung von 2-Cyclopentyl-3-oxobutylsäureethyl-
ester

25 Eine Mischung von 3-Oxobutylsäure ethylester (0,5 mol), Cyclopen-
tylbromid (0,5 mol) und Natriumethoxyat (0,5 mol) in Ethanol
(100 ml) wurde 15 Std. refluxiert. Nach Abkühlen der Reaktionsmi-
schung auf etwa 20 bis 25°C wurden 71g der Titelverbindung durch
Destillation (96-100°C, 0,25 mbar) isoliert.

30

Beispiel 2 Herstellung von 7-Hydroxy-6-cyclopentyl-5-me-
thyl-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin

35 Eine Mischung von 3-Amino-1,2,4-triazol (14 g), 2-Cyclopen-
tyl-3-oxobutylsäureethylester (0,17 mol, Bsp. 1) und Tributylamin
(50 ml) wurde für 6 Std. auf 180°C erhitzt. Nach Abkühlen der Re-
aktionsmischung auf etwa 70°C wurde wässr. NaOH-Lösung (21g in
200 ml H₂O) zugesetzt und die Lösung weitere 30 min gerührt. Nach
Phasentrennung und Extraktion mit Diethylether wurde die wässrige
40 Phase mit konz. HCl-Lösung angesäuert. Aus dem Niederschlag er-
hielt man 19g der Titelverbindung.

26

Beispiel 3 Herstellung von 7-Chlor-6-cyclopentyl-5-methyl-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin

Eine Mischung von 7-Hydroxy-6-cyclopentyl-5-methyl-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin (17 g, Bsp. 2) und POCl₃ (50 ml) wurde 8 Std. refluxiert. Dabei destillierte ein Teil des POCl₃ ab. Der Rückstand wurde in ein Dichlormethan/Wasser-Gemisch gegeben. Die organische Phase wurde abgetrennt und getrocknet. Nach Abtrennen des Lösungsmittels erhielt man 11g der Titelverbindung vom Fp. 87°C.

Beispiel 4 Herstellung von 6-Cyclopentyl-7-(4-methylpiperidin-N-yl)-5-methyl-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin [I-1]

Eine Lösung von 4-Methylpiperidin (1,5 mmol) und Triethylamin (1,5 mmol) 10ml Dichloromethan wurde unter Rühren zu einer Lösung von 7-Chlor-6-cyclopentyl-5-methyl-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin (1,5 mmol, Bsp. 3) in 20ml Dichlormethan gegeben. Die Reaktionsmischung wurde etwa 16 Std. bei 20 bis 25°C gerührt, dann mit 5%iger HCl-Lösung gewaschen. Die organische Phase wurde abgetrennt und getrocknet. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels und Chromatographie an Kieselgel wurden daraus 0,26g der Titelverbindung vom Fp. 145°C erhalten.

Tabelle I: Verbindungen der Formel I

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	phys. Daten (Fp. [°C]; IR [cm ⁻¹])
I-1	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cyclopentyl	CH ₃	145
I-2	^(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cyclopentyl	CH ₃	96
I-3	^(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cyclopentyl	CH ₃	108
I-4	H	H	Cyclopentyl	CH ₃	271
I-5	CH ₃	H	Cyclopentyl	CH ₃	175
I-6	^(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cyclopentyl	CH ₃	1960; 1605; 1590; 1240

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als 10%ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil®

27

LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Wettol® EM (nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ricinusöl) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Anwendungsbeispiel - Wirksamkeit gegen *Alternaria solani* an Tomaten

10 Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Große Fleischtomate St. Pierre" wurden mit einer wäßrigen Suspension, die aus einer Stammlösung aus 10 % Wirkstoff in einer Mischung von 70 % Cyclohexanon, 20 % Netzmittel und 27 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter
15 mit einer wäßrigen Zoosporenaufschwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von $0,17 \times 10^6$ Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krautfäule auf den unbehan-
20 delten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, daß der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

25

30

35

40

45

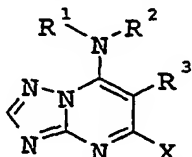
5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine, Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen

5

Zusammenfassung

5-Alkyl-7-aminotriazolopyrimidine der Formel I,

10



I

in der die Substituenten die folgenden Bedeutungen haben:

15

R¹, R² Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Haloalkyl, Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl; 5- oder 6-gliedriges gesättigtes, ungesättigtes oder aromatisches Heterocyclyl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom; oder

20

R¹ und R² können zusammen mit dem Stickstoffatom, das sie verbindet, einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält;

25

R³ Cycloalkyl oder Bicycloalkyl;

30

wobei R¹, R² und R³ gemäß der Beschreibung substituiert sein können;

X Alkyl;

35 sowie deren Salze;

Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel und ihre Verwendung zur Bekämpfung von phytopathogenen Schadpilzen.

40

45

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☒ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☐ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.